

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D 30 MAR 2005

WIPO

PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054147	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/14283	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 16.12.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 17.12.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D487/04		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

- ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  12.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  24.03.2005
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Helps, I  Tel. +49 89 2399-8209  

**I. Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

**Beschreibung, Seiten**

1-56 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Ansprüche, Nr.**

1-7 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbaren **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,      Seiten:
- ☐ Ansprüche,      Nr.:
- ☐ Zeichnungen,      Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)*

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER  
PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/14283

---

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-7
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche
	Nein: Ansprüche 1-7
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-7
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

**siehe Beiblatt**

## V. UNTERLAGEN UND ERLÄUTERUNGEN.

In diesem Bericht werden die folgende Dokumente zitiert.

WO-A-99 41255	(A)
WO-A-94 20501	(B)
EP-A-0,550,113	(C )
EP-A-0,071,792	(D)
WO-A-03 004465	(E)
WO-A-03 080615	(F)

Das neue strukturelle Merkmal der Verbindungen des Anspruchs 1 ist die Kombination der R1, R2 und X-Substituenten an den 6-Phenyl-triazolopyrimidine Ring. Der abhängige Anspruch 2, sowie der Anspruch 3, der ein Verfahren zur Herstellung den Verbindungen des Anspruchs 1 beschreibt, und die Ansprüche 5-7, die Verbindungen des Anspruchs 1 enthaltenden fungiziden Mittel und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Pilzen beschreiben, sind daher auch neu.

Das neue Merkmal der Verbindungen des Anspruchs 4 ist die X-Gruppe, gewählt aus S(O)mRx, NRxRy, und NxCO<sub>2</sub>Ry, an den Phenylring.

Die Ansprüche 1-7 erfüllen somit die Bestimmungen des Artikels 33(2) PCT (Neuheit).

Das Prioritätsdokument wurde überprüft, und das beanspruchten Prioritätsdatum scheint für alle beanspruchte Sachverhalt gültig zu sein. Die Zwischendokumente (E) und (F) werden für die Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit nicht in Betracht genommen.

6-Phenyl-Triazolopyrimidine sind aus dem Stand der Technik als Fungizide bekannt. Das Dokument (A) beschreibt 7-Alkyl-6-phenyl-5-halogeno-Triazolopyrimidine, worin der Phenylring durch Halogen, Alkyl, Alkoxy, NO<sub>2</sub> oder CN substituiert sein kann. Dokument (B) beschreibt weitere 6-Phenyl-5,7-Dihalogeno-Triazolopyrimidine, worin der Phenylring durch verschiedenen Gruppen einschließlich Amino, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl substituiert sein kann. Auch das Dokument (D) beschreibt 5-Alkyl-6-Phenyl-7-Amino-Triazolopyrimidine, worin der Phenylring Substituenten tragen kann, und 5,7-Diamino-6-Phenyl-Triazolopyrimidinen als Fungizide sind auch aus dem Dokument (C )

bekannt. Deshalb sind alle R1, R2, X und R Substituenten aus den Dokumenten (A)-(D) bekannt. Da das 6-Phenyl-triazolopyrimidin-Struktur ein bekanntes Biophor ist, und die beanspruchten Verbindungen lediglich ein willkürliches Kombination von bekannten Substituenten besitzen, könnte der Fachmann erwarten, das die beanspruchten Verbindungen auch eine fungizide Wirkung besitzen werden.

Deshalb ist eine erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT) nicht anzuerkennen, weil die der Anmeldung zugrundeliegenden Aufgabe (d.h. die Bereitstellung von weiteren Fungizide) in naheliegender Weise gelöst ist. Eine erfinderische Tätigkeit wäre nur anzuerkennen, falls die Anmelderin eine unerwartete Effekt für die beanspruchten Verbindungen im Vergleich mit den bekannten Verbindungen aus dem Stand der Technik mit der größtmöglichen Strukturnahe nachweisen könnte. Solchen Daten sind nicht vorhanden, und deshalb wurden die Bestimmungen des Artikels 33(3) EPÜ nicht erfüllt.

Die Zwischenprodukte des Anspruchs 4 wäre im Zusammenhang mit einem erfinderischen Hauptanspruch zulässig.

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/014283



# PCT

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 0000054147	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/014283	International filing date (day/month/year) 16 December 2003 (16.12.2003)	Priority date (day/month/year) 17 December 2002 (17.12.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 487/04, A01N 43/653		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of \_\_\_\_\_ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 12 May 2004 (12.05.2004)	Date of completion of this report 24 March 2005 (24.03.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP2003/014283

## I. Basis of the report

### 1. With regard to the elements of the international application:\*

- ☒ the international application as originally filed
- ☒ the description:  
 pages \_\_\_\_\_ 1-56 \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☒ the claims:  
 pages \_\_\_\_\_ 1-7 \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:  
 pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing part of the description:  
 pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
 pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

### 2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

### 3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

### 4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

### 5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\*

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP 03/14283

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-7	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-7	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-7	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

This report refers to the following documents:

WO-A-99 41255 (A)  
WO-A-94 20501 (B)  
EP-A-0,550,113 (C)  
EP-A-0,071,792 (D)  
WO-A-03 004465 (E)  
WO-A-03 080615 (F)

The novel structural feature of the compounds of claim 1 is the combination of  $R^1$ ,  $R^2$  and X substituents on the 6-phenyl-triazolopyrimidine ring. Dependent claim 2 as well as claim 3, which describes a method of preparing the compounds of claim 1, and claims 5-7, which describe fungicides containing compounds of claim 1 and their antifungal use, are therefore also novel.

The new feature of the compounds of claim 4 is the X group, selected from  $S(O)_m R^x$ ,  $NR^x R^y$ , and  $NR^x COR^y$ , on the phenyl ring.

Claims 1-7 thus meet the conditions of PCT Article 33(2) (novelty).



The priority document was examined, and the priority date appears to be valid for all substantive matter claimed. The intermediate citations (E) and (F) have not been taken into account for evaluating inventive step.

6-phenyl-triazolopyrimidines are known from the prior art as fungicides. Document (A) describes 7-alkyl-6-phenyl-5-halogeno-triazolopyrimidines wherein the phenyl ring can be substituted by halogen, alkyl, alkoxy, NO<sub>2</sub> or CN. Document (B) describes other 6-phenyl-5,7-dihalogeno-triazolopyrimidines wherein the phenyl ring can be substituted by various groups, including amino, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl. Document (D) also describes 5-alkyl-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidines wherein the phenyl ring can carry substituents, and 5,7-diamino-6-phenyl-triazolopyrimidines as fungicides are also known from document (C). Therefore, all the substituents R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X and R are known from documents (A)-(D). Since the 6-phenyl-triazolopyrimidine structure is a known biophore and the claimed compounds merely have an arbitrary combination of known substituents, a person skilled in the art could expect that the claimed compounds will also have a fungicidal effect.

Consequently, an inventive step (PCT Article 33(3)) cannot be recognized because the problem addressed by the application (i.e. the provision of further fungicides) has been solved in an obvious way. An inventive step were to be recognized only if the applicants could demonstrate for the claimed compounds an unexpected effect compared with the structurally most closely related compounds of the prior art. Such are not present and therefore the terms of PCT Article 33(3) have not been met.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

International application No.

PCT/JP 03/14283

The intermediates of claim 4 would be admissible in  
conjunction with an inventive main claim.